

СД-28. СИНТЕЗ

5-МЕТИЛСУЛЬФАНИЛТЕТРАЗОЛО[1,5-*a*]ПИРИМИДИН-7-ОНА

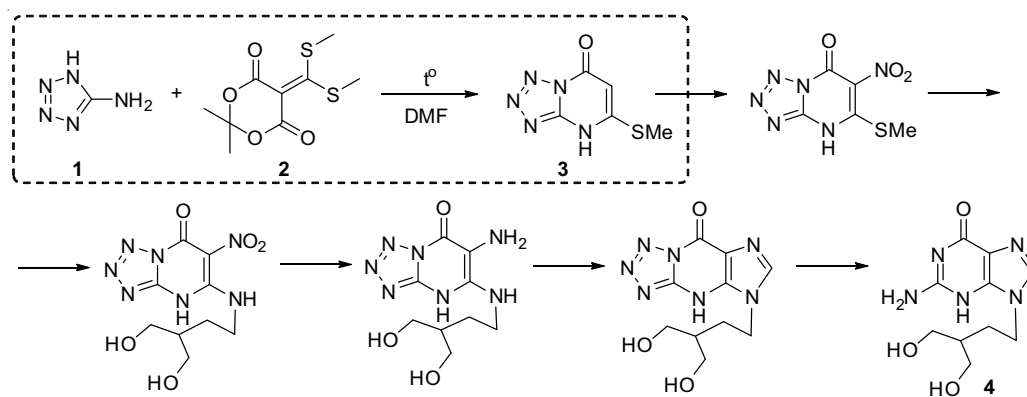
Н. И. Ефименко, Д. Н. Ляпустин, Е. К. Воинков, Е. Н. Уломский

Уральский федеральный университет им. первого Президента России Б. Н. Ельцина,
620002, Россия, Екатеринбург, ул. Мира, 19

E-mail: efimenkofiml@gmail.com

Тетразольный фрагмент в синтезе гетероциклических соединений имеет полезные свойства: во-первых, он является фармакофорным фрагментом; во-вторых, тетразольное кольцо способно мягко восстанавливаться с образованием аминогруппы. Такой синтетический прием известен для синтеза соединений ряда аминопуринов, получаемых из тетразоло[5,1-*b*]пуринов, однако линейные тетразоло[5,1-*a*]пурины не рассматривались в качестве исходных соединений для 2-аминопуринов, представленных рядом противовирусных средств. Аминопурины и полупродукты его синтеза и интересны с точки зрения поиска новых лекарственных средств.

Нами синтезировано соединение ряда тетразоло[1,5-*a*]пиримидинов – предшественников линейных тетразолопуринов. Эти соединения являются структурными аналогами природных пуринов и имеют ингибирующую способность по отношению к рецепторам природных пуриновых нуклеозидов. Используя предложенный синтетический путь, можно синтезировать уже известные лекарственные препараты, например противовирусный препарат пенцикловир **4**, схема получения которого представлена ниже.



Первой стадией в предлагаемой схеме синтеза линейных тетразоло[5,1-*a*]пуринов является циклоконденсация 5-(бисметилсульфанилметил)-2,2-диметил-1,3-диоксан-4,6-диона **2** с 5-аминотетразолом **1**. Одним из необходимых условий для успешного осуществления данных превращений является введение на ранних стадиях в положение 5 тетразолопиримидина легко уходящей метилсульфанильной группы с перспективой замены ее на N-нуклеофил. Образующийся 5-метилсульфанилтетразоло[1,5-*a*]пиримидин-7-он **3** впоследствии будет использован в качестве ключевого полупродукта; синтетический путь показан на схеме.

Таким образом, нами был получен 5-метилсульфанилтетразоло[1,5-*a*]пиримидин-7-он в качестве начального прекурсора в синтезе пенцикловира и его аналогов.

Работа выполнена при поддержке Российского научного фонда (грант № 16-13-00008).